

14. AUG. 2003

PVS

Deutsche  
Demokratische  
Republik



Amt  
für Erfindungs-  
und Patentwesen

# PATENTSCHRIFT

Wirtschaftspatent

Erteilt gemäß § 5 Absatz 1 des Änderungsgesetzes zum Patentgesetz

## 107 208

Zusatzpatent zum Patent: —

Anmeldetag: 04.06.73  
(WP A 61 j / 171 405)

Priorität: —

Ausgabetag: 20.07.74

Int. Cl.:  
A 61 j, 3/00

Kl.:  
30 g, 7/03

In der vom Anmelder eingereichten Fassung veröffentlicht

Erfinder: Butte, Dr. phil. Hans

Inhaber: VEB Sächsisches Serumwerk

Verfahren zur Herstellung von Medikamenten

107 208

3 Seiten

Die Erfindung betrifft ein Verfahren zum Einbringen von Medikamenten in Substanzen, die oral verabreicht werden.

Bei der Verabreichung von Medikamenten finden im wesentlichen zwei Wege Anwendung und zwar die sogenannte Injektion und die orale Verabreichung. In letzter Zeit geht man von der Injektion immer mehr ab, weil dazu in der Regel ein Arzt aufgesucht werden muß, und gibt der oralen Verabreichung den Vorzug. Außerdem verursacht die Injektion (von Impfstoffen) gelegentlich lästige Nebenerscheinungen.

Aber auch mit der oralen Schluckverabreichung sind Nachteile verbunden. Sie bestehen darin, daß die Wirkstoffe des Medikamentes im Magen-Darm-Kanal teilweise oder völlig unwirksam gemacht werden, und dadurch die angestrebte Heilwirkung ausfällt.

Der Zweck der Erfindung besteht darin, ein Verfahren zur Herstellung eines Medikamentes zu finden, bei dem die geschilderten Mängel, die den bisherigen Medikamenten anhaften, nicht mehr anzutreffen sind.

Zur Lösung dieser Aufgabe wird erfindungsgemäß das Medikament in eine Substanz eingebracht, die vom Mundspeichel aufgelöst und somit dieses Medikament von der Mundschleimhaut resorbiert wird.

Gemäß weiterer Ausbildung der Erfindung werden als Medikament in die Trägersubstanz Allergene und/oder Antigene und/oder Ergine eingearbeitet.

Gemäß weiterer Ausbildung der Erfindung können als Antigene, die in die Trägersubstanz eingearbeitet werden, insbesondere solche Verwendung finden, die gegen Shigellen, Salmonellen, Cholera, Coli und andere auf den Darm einwirkende Krankheitserreger wirksam sind.

Für besondere Zwecke kann es von Vorteil sein, wenn in die Substanz, die im Munde zur Auflösung gebracht wird, anaphylaktogene Materialien eingearbeitet werden.

Als besonders vorteilhaft hat es sich erwiesen, wenn die vorerwähnten Medikamente und gegebenenfalls andere Medikamente in Kaugummi eingearbeitet werden.

Wenn in der vorbeschriebenen Weise verfahren wird, erzielt man ein Medikament bzw. ein Mittel zur Behandlung des menschlichen Organismus, das mancherlei Vorteile mit sich bringt, so wird im Gegensatz zur Injektion und zur oralen Schluckverabreichung eine wesentlich bessere Wirkung erzielt, wenn die Medikamente, in denen die Allergene, Antigene und Ergine enthalten sind, buccal verabreicht werden. Sie werden also nicht geschluckt, sondern verbleiben so lange im Munde, bis sie durch den Speichel aufgelöst und durch die Mundschleimhaut aufgenommen werden, also nicht einer nachteiligen Einwirkung der Magensäfte ausgesetzt sind.

Auf diese Weise gelangen die Wirkstoffe der Medikamente unbeschädigt zur Resorption und die angestrebte Wirkung wird bei buccaler Verabreichung schneller erzielt als bei der Schluckverabreichung.

Wesentlich ist auch der Umstand, daß sich in die Trägersubstanz eine hohe gewichtsmäßig dosierte Anzahl von Wirkstoffen einarbeiten läßt, so daß z. B. 70 und mehr Einzelallergene in einer Einheit enthalten sind.

Ein weiterer Vorteil der mit dem erfindungsgemäßen Verfahren hergestellten Produkte beruht ferner darin, daß es möglich ist, die Füllstoffe, in die die Medikamente eingebracht werden, so zusammenzusetzen, daß die Dauer ihrer Zerfallbarkeit im Munde in weiten Grenzen variabel ist.

Vielfach stößt die Verabreichung von Medikamenten auf Schwierigkeiten, weil die Patienten eine Abneigung gegen das in Frage stehende Medikament besitzen. Diese Abneigung kann verschiedene Gründe haben. So sind z. B. manche Patienten nicht bereit, ein Medikament einzunehmen, wenn es in Tablettenform angeboten wird.

Auch Kinder und Jugendliche haben gegen Medikamente ihre Vorurteile. Für alle diese mit Vorurteilen behafteten Patienten kann somit die Einnahme des Medikamentes attraktiver gestaltet werden, wenn als Substanz, in die das Medikament eingebracht wird, Kaugummi Verwendung findet. Dieser wird insbesondere von Jugendlichen gern genommen. Dabei wird eine besonders günstige Aufnahme des Medikamentes durch die allmähliche Extraktion aus dem Kaugummi während des Kauens erzielt. Dabei wandert der Kaugummi im Munde nacheinander während des Kauens an verschiedene Stellen der Mundschleimhaut, so daß in dauernder Folge eine besonders günstige Aufnahme der Wirkstoffe an verschiedenen Stellen innerhalb des Mundes erfolgen kann.

Ein weiterer wesentlicher Vorteil bei der Einbringung des Medikamentes in Kaugummi besteht darin, daß es dabei möglich ist, die Konzentration, in der die Allergene in der Trägersubstanz untergebracht sind, fast beliebig zu erhöhen und außerdem dieselben in ihrer natürlichen Erscheinungsform auch aufgeschlossen zu verwenden. Dabei ist eine exakte gewichtsmäßige Dosierung ohne Schwierigkeiten durchzuführen zum Unterschied von der bisher üblichen Verabreichung von Extrakten.

Die Einbringung der Medikamente in Kaugummi bringt weiter den wesentlichen Vorteil mit sich, daß die Schwierigkeiten, die bei der Tablettierung auftreten, völlig in Wegfall kommen.

Bei der Einbringung der Medikamente in den Kaugummi besteht außerdem der große Vorteil, daß gewisse Ingredienzien in den Kaugummi eingebracht werden können, so daß von ihnen der Eigengeschmack des Medikamentes völlig überdeckt werden kann, so daß namentlich von Jugendlichen nicht angenehm schmeckende Medikamente gern genommen werden.

#### Beispiel 1:

Zur Herstellung einer Tablette mit natürlichen Allergenen

0,0720 g Wirkstoff (vollallergen)  
0,0035 g Talkum  
0,0030 g Stearinsäure  
0,0020 g Paraffin  
0,0050 g Gelatine  
0,0745 g Puderzucker  
0,1600 g Gewicht einer Tablette

#### Beispiel 2:

20 g Kaugummimasse werden auf dem Wasserbad oder anderer entsprechender Wärmequelle erweicht und mit der benötigten Menge Wirkstoff, z. B. 7,1 g Pollen, homogen verarbeitet und bei etwa 40 bis 45°C geformt.

#### Beispiel 3:

20 g Kaugummimasse werden bei gelinder Temperatur, siehe Beispiel 2, mit Bakterien, z. B. 5 g Salmonellen, Shigellen, Coli u. a. Trockenantigenen verknetet und geformt.

Die Kaugummimasse wird bei gelinder Wärme knetbar gemacht und die zu applizierende Substanz, z. B. Aller-

gene aus Pollen und anderen Pflanzenteilen, wie Blätter, in die Masse eingearbeitet. Als Allergene können aber auch Bestandteile tierischer Herkunft, wie Haare in geeigneter Form Verwendung finden sowie andere Substanzen, wie Hausstaub, d. h. also alles, was in den Bereich der Allergene gehört.

Es besteht weiterhin die Möglichkeit, diese Substanzen auch als Lösungen oder Suspensionen in die Kaugummimasse einzubringen. Unter Allergenen sollen hier auch Bakterien, Viren, Phagen und Extrakte bzw. Teilsubstanzen daraus, verstanden sein. Dazu gehören auch Antigene zur Seuchenbekämpfung.

#### Patentansprüche:

1. Verfahren zur Herstellung von Medikamenten, dadurch gekennzeichnet, daß das Medikament in eine zu einer Tablette gepreßte Substanz eingebracht wird, die vom Mundspeichel aufgelöst und von der Mundschleimhaut gemeinsam mit dem Medikament resorbiert wird.

2. Verfahren nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß in die Trägersubstanz Allergene und/oder Antigene und/oder Ergine eingearbeitet werden.

3. Verfahren nach Anspruch 2, dadurch gekennzeichnet, daß als Antigene, die in die Trägersubstanz eingearbeitet werden, insbesondere solche Verwendung finden, die gegen Shigellen, Salmonellen, Cholera, Coli und andere auf den Darm einwirkende Krankheitserreger eine prophylaktische Wirkung ausüben.

4. Verfahren nach Anspruch 3, dadurch gekennzeichnet, daß in die Substanz, die im Munde zur Auflösung gebracht wird, anaphylaktogene Materialien eingearbeitet werden.

5. Verfahren nach Anspruch 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, daß durch Auswahl der Füllstoffe, die die Trägersubstanz bilden, die Dauer der Zerfallbarkeit einer Tablette im Munde in weiten Grenzen einstellbar ist.

6. Verfahren nach Anspruch 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, daß als Trägersubstanz für die Medikamente Kaugummi Verwendung findet.

7. Verfahren nach Anspruch 6, dadurch gekennzeichnet, daß dem Kaugummi geschmacksverbessernde Zusätze beigelegt werden, die den Geschmack des Medikamentes teilweise oder völlig überdecken.